

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2004 年12 月29 日 (29.12.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/112751 A1

(51) 国際特許分類⁷: A61K 9/16, 47/02, 47/04, 9/19

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/008188

(22) 国際出願日: 2004 年6 月11 日 (11.06.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2003-173431 2003 年6 月18 日 (18.06.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 株式会社 LTT バイオファーマ (LTT BIO-PHARMA CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1056201 東京都港区愛宕 2 丁目 5 番 1 号 Tokyo (JP). 独立行政法人物質・材料研究機構 (INDEPENDENT ADMINISTRATIVE INSTITUTION, NATIONAL INSTITUTE FOR MATERIALS SCIENCE) [JP/JP]; 〒3050047 茨城県つくば市千現 1 丁目 2 番 1 号 Ibaraki (JP).

(71) 出願人 および

(72) 発明者: 小川 泰亮 (OGAWA, Yasuaki) [JP/JP]; 〒6180071 京都府乙訓郡大山崎町字大山崎小字谷田 7 7 番 4 2 号 Kyoto (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 水島 裕 (MIZUSHIMA, Yutaka) [JP/JP]; 〒1060032 東京都港区六本木 6-1 2-3 Tokyo (JP). 田中 順三 (TANAKA, Junzou) [JP/JP]; 〒3050047 茨城県つくば市千現 1 丁目 2 番 1 号 独立行政法人物質・材料研究機構内

Ibaraki (JP). 生駒 俊之 (IKOMA, Toshiyuki) [JP/JP]; 〒3050047 茨城県つくば市千現 1 丁目 2 番 1 号 独立行政法人物質・材料研究機構内 Ibaraki (JP).

(74) 代理人: 高橋 剛, 外 (TAKAHASHI, Takeshi et al.); 〒1030027 東京都中央区日本橋 3 丁目 6 番 1 0 号 マスキビル 3 F Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: DRUG-CONTAINING SUSTAINED RELEASE MICROPARTICLE, PROCESS FOR PRODUCING THE SAME AND PREPARATION CONTAINING THE MICROPARTICLE

(54) 発明の名称: 薬物含有徐放性微粒子、その製造法、及びそれを含有する製剤

(57) Abstract: Sustained release microparticles suitable for various types of drugs, or drug-containing sustained release microparticles capable of sustained release of drugs over a period of three days or more and capable of, with respect to highly water-soluble drugs as well, inhibiting initial burst release; a process for producing the same; and preparations containing the microparticles. In particular, the drug-containing sustained release microparticles comprise a drug other than human growth hormone and a porous apatite derivative, or comprise a drug other than human growth hormone, a porous apatite derivative and a water-soluble bivalent metal compound. The drug-containing sustained release microparticles can be produced by dispersing under agitation microparticles of a porous apatite derivative in an aqueous solution containing a drug so that the aqueous solution infiltrates in the porous apatite derivative; adding thereto an aqueous solution containing a water-soluble bivalent metal compound so that the water-soluble bivalent metal compound infiltrates in the porous apatite derivative; further adding additives such as a stabilizer to the mixture; and effecting lyophilization or vacuum drying.

(57) 要約: 種々の薬物に関する徐放性微粒子を得ること、又少なくとも 3 日間以上にわたり薬物が徐放され、かつ水溶性の高い薬物においても初期バースト放出を抑制することが出来る薬物含有徐放性微粒子、その製造法、及びそれを含有する製剤を提供することにある。ヒト成長ホルモンを除く薬物、及び多孔性アパタイト誘導体からなり、かつ、ヒト成長ホルモンを除く薬物、多孔性アパタイト誘導体および水溶性 2 価金属化合物からなる。多孔性アパタイト誘導体の微粒子を薬物含有の水溶液中に攪拌・分散し、水溶液が該多孔性アパタイト誘導体中に浸潤したのち水溶性 2 価金属化合物を含む水溶液を添加し、水溶性 2 価金属化合物を該多孔性アパタイト誘導体に浸潤させ、その後安定剤などの添加物を加えて、凍結乾燥または真空乾燥することにより製造されることからなる。

WO 2004/112751 A1